

# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2001-158730  
(43)Date of publication of application : 12.06.2001

(51)Int.CI. A61K 7/48  
A61K 7/00

(21)Application number : 11-344041

(71)Applicant : POLA CHEM IND INC  
YAMAMOTO ITARU

(22)Date of filing : 03.12.1999

(72)Inventor : YAMAMOTO ITARU  
SETO MASATO  
KAWAI MITSUO  
YAMASHITA TOKIO  
SUGIYAMA SEIJI

## (54) COSMETIC FOR IMPROVING DARK SKIN COLOR

### (57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide a cosmetic useful for improving dark skin color.

SOLUTION: This cosmetic characterized by containing a 6-acylascorbic acid-2-glucoside and 1,3-butanediol.

## LEGAL STATUS

[Date of request for examination] 22.12.2003

[Date of sending the examiner's decision of rejection] 10.05.2005

[Kind of final disposal of application other than the  
examiner's decision of rejection or application  
converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of  
rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision  
of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19)日本国特許庁 (JP)

(12)公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2001-158730

(P2001-158730A)

(43)公開日 平成13年6月12日(2001.6.12)

(51) Int.C1. <sup>7</sup>	識別記号	F I	マークコード (参考)
A61K 7/48		A61K 7/48	4C083
7/00		7/00	C
			D

審査請求 未請求 請求項の数 5 O.L. (全 6 頁)

(21)出願番号	特願平11-344041	(71)出願人 000113470 ポーラ化成工業株式会社 静岡県静岡市弥生町6番48号
(22)出願日	平成11年12月3日(1999.12.3)	(71)出願人 598049344 山本 格 岡山県岡山市花尻ききょう町1番地の102
		(72)発明者 山本 格 岡山県岡山市花尻ききょう町1番地の102
		(72)発明者 濱戸 匠人 神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1 ポーラ化成工業株式会社ポーラ横浜研究所 内
		最終頁に続く

(54)【発明の名称】くすみ改善用の化粧料

(57)【要約】

【課題】 本発明は、くすみ改善に有益な化粧料を提供することを課題とする。

【解決手段】 6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシドと1,3-ブタジオールとを皮膚外用剤に含有させる。

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシドと1, 3-ブタンジオールとを含有することを特徴とする、化粧料。

【請求項2】 6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシドのアシル基が炭素数6～20の脂肪族のアシル基であることを特徴とする、請求項1に記載の化粧料。

【請求項3】 更に、次に挙げる多価アルコールから選ばれる1種乃至は2種以上を含有することを特徴とする、請求項1又は2に記載の化粧料。(多価アルコール)グリセリン、ジグリセリン、ジプロピレングリコール、1, 2-ペンタンジオール、イソペンチルグリコール

【請求項4】 くすみの改善用であることを特徴とする、請求項1～3何れか1項に記載の化粧料。

【請求項5】 敏感肌用であることを特徴とする、請求項1～4何れか1項に記載の化粧料。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、化粧料に関し、更に詳細には、くすみの改善に有用な化粧料に関する。

## 【0002】

【従来の技術】現代はストレスの時代であり、現代に生きる人間は過去と比べるべくもないほどのストレスを受けて生きている。この様な過剰なストレスは様々な影響を人体に与え、皮膚などの部位もその例外ではない。皮膚に於けるこの様なストレスの影響は、例えば、化学物質などに過敏に反応する化学物質過敏症やアトピー性皮膚炎などの形で現れている。これはストレスにより、皮膚防御機能が低下しているのが一因と言われている。この為、この様な人たちに於いては、化粧料などの皮膚外用剤も使いにくい状況であるし、肌荒れや炎症に起因した色素の沈着、即ちくすみなどの好ましくない肌反応も現れている。

【0003】この様なストレスの肌に対する影響を還元する手だてとしては、グリセリンなどの保湿性の強い成分を含む皮膚外用剤による処置が為されているが、これに於いてもバリア機能を補完するものの、肌状態の改善には至っていないのが現状であり、この様な肌に於ける、色素の沈着やくすみの改善については殆ど打つ手がないのが現状であった。

【0004】一方、6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシドと1, 3-ブタンジオールを組み合わせる技術については、全く知られておらず、この様な組合せが、バリア機能の不全な肌に於いても安全に使用でき、くすみなどを改善しうることも全く知られていなかった。

## 【0005】

【発明が解決しようとする課題】本発明は、この様な状況下でされたものであり、くすみ改善に有益な化粧料を提供することを課題とする。

## 【0006】

【課題の解決手段】本発明者らは、この様な状況に鑑みて、くすみ改善に有益な化粧料を求めて、鋭意研究努力を重ねた結果、6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシドと1, 3-ブタンジオールを組み合わせて、化粧料に含有することにより、この様な化粧料の提供ができるを見出し、発明を完成させるに至った。即ち、本発明は、6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシドと1, 3-ブタンジオールとを含有する化粧料を提供するものである。更に、本発明は、更に好ましい態様として、これらに加えてグリセリン、ジグリセリン、ジプロピレングリコール、1, 2-ペンタンジオール及びイソペンチルグリコールから選ばれる1種乃至は2種以上を含有する化粧料を提供するものである。

## 【0007】

【発明の実施の形態】(1) 本発明の必須成分である6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシド  
本発明の皮膚外用の組成物は、6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシドを含有することを特徴とする。ここで、アシル基としては炭素数6～18のものが好ましく、中でも炭素数8のものが特に好ましい。これは、この様な6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシドに安全性を損なうこと無く、親水性の界面活性作用が有るためである。かかるアシル基としては、直鎖、分岐構造を有するもの、環状構造を有するものの何れもが可能であるが、これらの内では直鎖のものが好ましく、例えば、オクタノイル基、デカノイル基、ドデカノイル基などが好ましく例示できる。この様な6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシドの製法は既に知られており、それに従って製造することができる。例えば、酸と塩化チオニル等のハロゲン化剤を反応させて作成できる酸ハライドや酸ハライドと酸を反応させて得られる酸無水物等を原料に、大過剰の溶媒と大過剰のアスコルビン酸-2-グルコシドをピリジンやトリエチルアミン等のアルカリ存在下、緩和な条件で徐々に反応させることによりかかる6-アシル化物を製造することができる。アルカリとしてピリジンやトリエチルアミンなどを用いると溶媒も兼ねられるので特に好ましい。その他、使用できる溶媒としては、アシルハライドや酸無水物に反応しないものであれば良く、例えば、アセトニトリルやエーテル類、ハロゲン化炭化水素などが好適に例示できる。この時、グルコースの6位にアシル基が導入されたアシル化物も副精製物として得られるが、このものはシリカゲル、ODSなどを担体に用いたカラムクロマトグラフィーによって除去することができる。この時の溶媒系としては、特段の限定はないが、担体がシリカゲルであれば、クロロホルム-メタノール-水系や石油エーテル-ジエチルエーテル-メタノール-水系が例示できるし、担体がODSであれば、アセトニトリル-水系やメタノール-水系などが例示でき、担体がダイアイオンHP-20等のイ

オン交換樹脂であれば、水ーエタノール系などが例示できる。これらアスコルビン酸-2-グルコシドのアシリ化物は唯一種を用いることもできるし、2種以上を組み合わせて用いることもできる。本発明の皮膚外用の組成物に於ける、6-アシリアスコルビン酸-2-グルコシドの好ましい含有量は、0.01~10重量%であり、更に好ましくは0.05~5重量%である。これは、この量範囲にある場合、6-アシリアスコルビン酸-2-グルコシドは皮膚外用の組成物に於いて、刺激感等の発現を抑えて、くすみを改善する作用を發揮できるためである。

【0008】(2) 本発明の化粧料の必須の成分である1,3-ブタンジオール

本発明の必須の成分である1,3-ブタンジオールは、上記の必須の成分である6-アシリアスコルビン酸-2-グルコシドのくすみの改善効果を製剤系に於いて高める作用を有する。これは、6-アシリアスコルビン酸-2-グルコシドの物理化学的な特性が、親水基と親油基とを有するため、界面活性剤としての作用を有するため、通常の製剤系に於いては、作用すべき部位への配向が少なくなる傾向にあり、本発明の化粧料の必須成分である、1,3-ブタンジオールを加えることにより、この様な傾向を改善することができる。この様な作用を発現する為には、1,3-ブタンジオールは、化粧料全量に対して、少なくとも3重量%が必要であり、好ましくは4重量%以上である。又、製剤的な自由度や安定性等への影響を考えると、上限値としては10重量%であり、更に好ましくは7重量%である。即ち、本発明の化粧料に於ける、1,3-ブタンジオールの好ましい含有量は、3~10重量%であり、更に好ましくは、4~7重量%である。

【0009】(3) 本発明の化粧料の好ましい成分

上記、1,3-ブタンジオールの効果を更に高める目的から、本発明では、次に示す多価アルコールから選ばれる1種乃至は2種以上を含有することが好ましい。即ち、グリセリン、ジグリセリン、ジプロピレンジコール、1,2-ペンタンジオール及びイソペンチルグリコールから選ばれる1種乃至は2種以上である。この内、グリセリン、ジグリセリンは効果増強のみならず、敏感肌に於けるバリア機能を改善する作用があるので、又、1,2-ペンタンジオールは防腐作用増強効果を有することから、防腐剤を減量し、これに起因するアレルギー反応の発現の可能性を低める作用を有する為、前述の多価アルコールの中では特に好ましいグループである。これら多価アルコールの好ましい含有量は、1~7重量%であり、更に好ましくは2~5重量%である。

【0010】(4) 本発明の化粧料

本発明の化粧料は、上記必須成分及び場合により好ましい成分を含有することを特徴とする。本発明の化粧料では、これらの成分以外に、通常化粧料で使用されている

任意の成分を含有することができる。かかる任意成分としては、例えば、スクワラン、ワセリン、マイクロクリスタリンワックス等の炭化水素類、ホホバ油、カルナウバワックス、オレイン酸オクチルドデシル等のエステル類、オリーブ油、牛脂、椰子油等のトリグリセライド類、ステアリン酸、オレイン酸、リチノレイン酸等の脂肪酸、オレイルアルコール、ステアリルアルコール、オクチルドデカノール等の高級アルコール、スルホコハク酸エステルやポリオキシエチレンアルキル硫酸ナトリウム等のアニオン界面活性剤類、アルキルベタイン塩等の両性界面活性剤類、ジアルキルアンモニウム塩等のカチオン界面活性剤類、ソルビタン脂肪酸エステル、脂肪酸モノグリセライド、これらのポリオキシエチレン付加物、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤類、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール等の多価アルコール類、増粘・ゲル化剤、酸化防止剤、紫外線吸収剤、色剤、防腐剤、粉体等を例示することができる。本発明の化粧料としては、通常知られている携帯のものであれば、特段の限定無く適用でき、例えば、化粧水、乳液、クリーム、パックなどの基礎化粧料、アンダーメーカップ、ファンデーション、白粉、口紅、頬紅等のメークアップ化粧料、トニック、シャンプー、リンス等の頭髪用化粧料、石鹼、ボディーシャンプー、ボディーローション等のボディー用化粧料等が例示できる。本発明の化粧料は、これらの必須成分、好ましい成分及び任意成分を常法に従って処理することにより得ることができる。かくして得られた、本発明の化粧料は、色黒とは異なり、通常の美白化粧料では改善することのできない、くすみを改善する作用に優れる。又、化学物質に対して敏感な所謂敏感肌の人が使用しても、刺激やトラブルの発現が少なく非常に有用である。加えて、トラブルや刺激により生じたくすみなどの色素沈着も改善できる。

【0011】  
【実施例】以下に実施例を挙げて、本発明について更に詳細に説明を加えるが、本発明がかかる実施例にのみ限定を受けないことは言うまでもない。

【0012】<実施例1>以下に示す処方に従って、化粧水を作成した。即ち、処方成分を攪拌可溶化し化粧水を得た。これの化粧水について、上腕部を用いた紫外線色素沈着モデルを用いて、その改善作用をラフスクリーニングした。即ち、上腕部に2cm×3cmの部位を5つ作り、ここに最少紅斑照射量の1/3の紫外線を1日1回連続5日照射し、色素沈着を生じさせた。この色沈部位1個に1化粧料を0.03ml1日1回14日連続して塗布した。最後の投与の24時間後に色素沈着の改善を判定した。色素沈着の改善は、++:光対照に比し著しく改善、+:光対照に比し明らかに改善、±:光対照より若干改善、-:改善せずの基準で判定した。結果

5  
を表1に示す。これより、本発明の化粧料は6-アシル  
アスコルビン酸-2-グルコシドの色素沈着改善効果を

増強させる働きがあることがわかる。(光対照:光照射  
は行うが化粧水の投与は行わない。)

6-オクタノイルアスコルビン酸-2-グルコシド	0.1重量部
多価アルコール*	5重量部
ヒアルロン酸ナトリウム	0.1重量部
硫酸化トレハロースナトリウム	0.1重量部
ヘパリン類似物質	0.1重量部
クジンエキス	1重量部
ローヤルゼリー	0.1重量部
シラカバエキス	0.1重量部
キンギンカエキス	0.1重量部
ローズマリーエキス	0.1重量部
セージエキス	0.1重量部
エタノール	5重量部
メチルパラベン	0.1重量部
水	87.9重量部

\*詳細は表1に示す。

【0013】

【表1】

サンプル	多価アルコール	評価
実施例1	1, 3-ブタンジオール	++
比較例1	ポリエチレングリコール1500	±
比較例2	プロピレングリコール	±
対照	水	±

【0014】<実施例2~7>下記に示す処方に従って化粧水を作成した。即ち、処方成分を攪拌可溶化し、化粧水を得た。このものを老齢の有色モルモットを用いて、色調の変化を調べた。このモデルは、色素沈着のみならず、加齢に起因する形態変化による色調(見た目)も併せて評価するモデルである。即ち、老齢有色モルモット(24週齢、雄性)1群6匹の背部を剃毛し、1.5cm×1.5cmの部位を作成し、化粧水を1日1回0.01ml連続14日塗布し、最終投与の24時

間後に、++:無処置の部位に比して著しく色調が明るい、+:無処置の部位に比して明確に色調が明るい、±:無処置の部位に比してやや色調が明るい、-:無処置の部位に比して色調が明るくないの基準で判定した。結果を表2に示す。これより、本発明の化粧料に於いては、グリセリン、ジグリセリン、ジプロピレングリコール、1, 2-ペンタンジオール及びイソペンチルグリコールを1, 3-ブタンジオール以外に含有することが好ましいことがわかる。

6-オクタノイルアスコルビン酸-2-グルコシド	0.1重量部
多価アルコール**	5重量部
1, 3-ブタンジオール	5重量部
ヒアルロン酸ナトリウム	0.1重量部
硫酸化トレハロースナトリウム	0.1重量部
ヘパリン類似物質	0.1重量部
クジンエキス	1重量部
ローヤルゼリー	0.1重量部
シラカバエキス	0.1重量部
キンギンカエキス	0.1重量部
ローズマリーエキス	0.1重量部
セージエキス	0.1重量部
エタノール	5重量部
メチルパラベン	0.1重量部
水	82.9重量部

\*\*詳細は表2に示す。

【0015】

50 【表2】

サンプル	多価アルコール	++	+	±	-
実施例1	—	1	4	1	
実施例2	グリセリン	4	2		
実施例3	ジグリセリン	3	2	1	
実施例4	ジプロピレンジリコール	2	4		
実施例5	1, 2-ベンタジオール	2	4		
実施例6	イソブレンジリコール	2	4		
実施例7	1, 3-ブタンジオール	1	5		
比較例2	ポリエチレンジコール1800	2	4		
比較例3	マルテトール	2	4		
比較例4	ソルビトール	2	4		

【0016】<実施例8>上記実施例1～7の化粧水について、モルモット損傷皮膚モデルでその刺激発現性を調べた。即ち、ハートレー系白色種モルモット1群5匹の背部を剃毛し、ガムテープで5回ストリッピングし損傷皮膚モデルを作成した。このものに本発明の化粧水を24時間クローズドパッチした。パッチ除去後1時間に皮膚反応をドレーズの基準で判定した。即ち、++:浮

6-デカノイルアスコルビン酸-2-グルコシド	0. 1 重量部
グリセリン	5 重量部
1, 3-ブタンジオール	5 重量部
ヒアルロン酸ナトリウム	0. 1 重量部
硫酸化トレハロースナトリウム	0. 1 重量部
ヘパリン類似物質	0. 1 重量部
クジンエキス	1 重量部
ローヤルゼリー	0. 1 重量部
シラカバエキス	0. 1 重量部
キンギンカエキス	0. 1 重量部
ローズマリーエキス	0. 1 重量部
セージエキス	0. 1 重量部
エタノール	5 重量部
メチルパラベン	0. 1 重量部
水	82. 9 重量部

【0019】<実施例11>下記に処方を示す如く、6-アシルアスコルビン酸-2-グルコシドの種類を変えて、実施例1～7と同様にくすみ改善効果を見た。結果

6-ドデカノイルアスコルビン酸-2-グルコシド	0. 1 重量部
グリセリン	5 重量部
1, 3-ブタンジオール	5 重量部
ヒアルロン酸ナトリウム	0. 1 重量部
硫酸化トレハロースナトリウム	0. 1 重量部
ヘパリン類似物質	0. 1 重量部
クジンエキス	1 重量部
ローヤルゼリー	0. 1 重量部
シラカバエキス	0. 1 重量部
キンギンカエキス	0. 1 重量部
ローズマリーエキス	0. 1 重量部
セージエキス	0. 1 重量部
エタノール	5 重量部
メチルパラベン	0. 1 重量部
水	82. 9 重量部

【0020】<実施例20>以下に示す処方に従って、乳液を作成した。即ち、イ、ロ及びハの成分をそれぞれ70℃に加熱し、イにロを加えて中和し、これにハを徐

々に加え乳化し、ホモミキサーをかけて乳化粒子を均質化し、攪拌冷却して乳液を得た。このものは安全性が優れる上に優れたくすみ改善作用を有していた。

9

イ)

6-オクタノイルアスコルビン酸-2-グルコシド	0. 1 重量部
アクリル酸・アクリル酸 (C10~30) アルキル	
コポリマー (ペムレンTR2)	0. 3 重量部
1, 3-ブantanジオール	4 重量部
グリセリン	3 重量部
1, 2-ペンタンジオール	3 重量部
キサンタンガム	0. 1 重量部
水	39. 5 重量部
口)	
水酸化カリウム	0. 2 重量部
水	36. 8 重量部
ハ)	
スクワラン	5 重量部
ホホバ油	5 重量部
ウンデシレン酸モノグリセリド	3 重量部

【0021】

粒料を提供することができる。

【発明の効果】本発明によれば、くすみ改善に有益な化

フロントページの続き

(72)発明者 河合 充夫

神奈川県横浜市戸塚区柏尾町560 ポーラ  
化成工業株式会社ポーラ戸塚研究所内

(72)発明者 山下 登喜雄

神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1  
ポーラ化成工業株式会社ポーラ横浜研究所  
内

(72)発明者 杉山 清治

神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1  
ポーラ化成工業株式会社ポーラ横浜研究所  
内F ターム(参考) 4C083 AA072 AA112 AA122 AB032  
AC022 AC102 AC111 AC112  
AC121 AC122 AC422 AC482  
AD041 AD042 AD092 AD111  
AD112 AD201 AD202 AD212  
AD312 AD332 AD352 AD641  
AD642 BB51 CC01 CC04  
CC05 DD23 DD31 EE12